

Таким образом, нами впервые получены энантиомеры планарно-хиральной аминокислоты **5** на основе *нидо*-карборана, а также ее бензильного эфира **3**. Данные соединения представляют интерес в качестве строительных блоков для получения энантиочистых карборансодержащих производных биомолекул, а также хиральных лигандов.

Список литературы

1. Barth R. F., Mi P., Yang W. // Cancer Commun. 2018. Vol. 38, № 1. Art. 35.
2. Luderer M. J., De La Puente P., Azab A. K. // Pharm. Res. 2015. Vol. 32, № 9. P. 2824–2836.
3. Boron-Based Compounds: Potential and Emerging Applications in Medicine / eds. by Hey-Hawkins E., Viñas Teixidor C. 1-st edition. Wiley, 2018. 496 p.
4. Gruzdev D. A., Ustinova V. O., Chulakov E. N. et al. // J. Organomet. Chem. 2018. Vol. 876, № 1. P. 50–56.

* Работа выполнена в рамках тем государственного задания АААА-А19-119012490007-8 и АААА-А19-119011790130-3 при финансовой поддержке РФФИ (проект № 18-33-00027 мол_а).

УДК 547.749

Ю. А. Титова, И. Г. Овчинникова,
О. В. Федорова, Г. Л. Русинов, В. Н. Чарушин

Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН,
620108, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, 22,
titova@ios.uran.ru

4-ГИДРОКСИПРОЛИНСОДЕРЖАЩИЙ КРАУНОФАН – НОВЫЙ ЭФФЕКТИВНЫЙ ХИРАЛЬНЫЙ ИНДУКТОР РЕАКЦИИ БИДЖИНЕЛЛИ*

Ключевые слова: краунофан, поданды, гидроксипролин, асимметрический синтез, реакция Биджинелли.

Использование C_2 -симметричных диолов и диаминов в качестве хиральных органокатализаторов в асимметрическом синтезе является одним из основных трендов последнего десятилетия. Наличие в таких катализаторах нескольких координационных центров, способных к обратимому образованию ковалентных и нековалентных (ионных, водородных и др.) связей с реагентами, обеспечивает оптимальное расположение последних в переходных состояниях и в конечном счете высокую энантиоселективность реакций [1].

Ранее, предполагая, что способность полиэфиров координировать катионы и (или) органические молекулы [2, 3] может повысить эффективность хирального катализатора, мы впервые осуществили синтез подандов (схема 1), в которых сочетаются олигоэфирный спейсер и (2*S*,4*R*)-гидроксипролиновый остаток. Было показано, что бикатионы **1a-c** проявляют стереокаталитическую активность в реакции Биджинелли (схема 2). Дигидропиримидинон **2** образовывался с энантиомерным избытком (*ee*) 62–68 % [4].

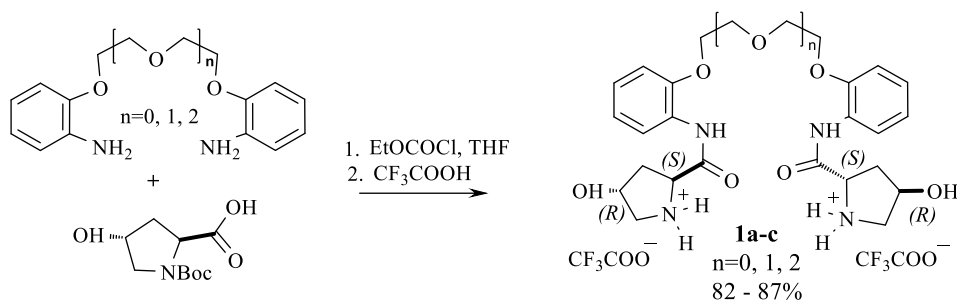


Схема 1. Синтез (2*S*, 4*R*)-гидроксипролинсодержащих подандов **1a-c**

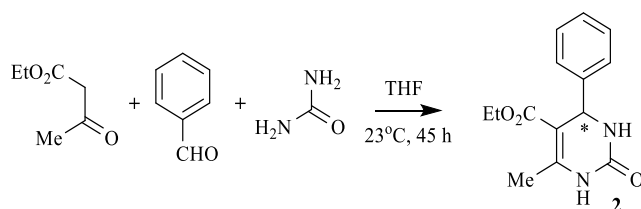


Схема 2. Синтез дигидропиримидинона **2** через асимметрическую реакцию Биджинелли

Далее в процессе разработки методов синтеза подандов, в которых (2*S*,4*R*)-4-гидроксипролиновый фрагмент соединен с аминогруппой через метиленовую группу, при восстановительном аминировании формил-поданда **3** неожиданно был получен макроцикл **4** (схема 3). Последующим омылением формиатной группы был получен аминосодержащий краунофан **5** с выходом ~ 94 %, который путем взаимодействия с Вос-защищенным (2*S*,4*R*)-гидроксипролином был превращен в гидроксипролинсодержащий краунофан **6**.

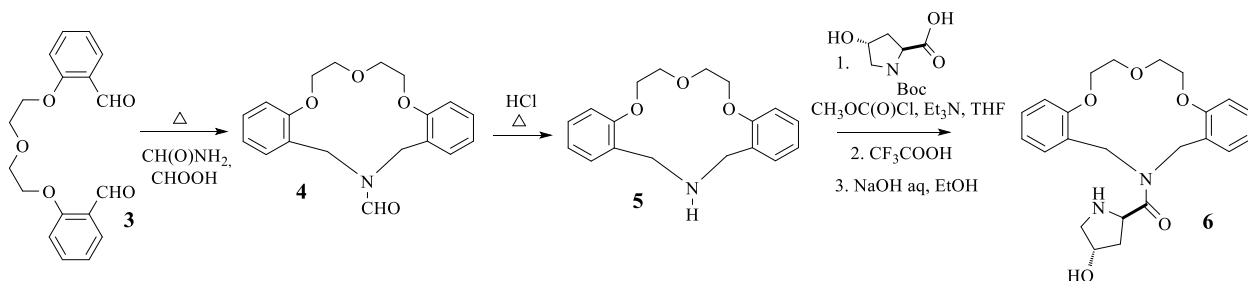


Схема 3. Синтез (2*S*,4*R*)-гидроксипролинсодержащего краунофана **6**

Исследование краунофана **6** в качестве хирального индуктора реакции Биджинелли позволило получить дигидропиримидинон **3** с *ee* 82 % без каких-либо хиральных или нехиральных добавок.

Таким образом, нами получен новый хиральный индуктор реакции Биджинелли, который представляет интерес для дальнейшей оптимизации с целью увеличения хемо- и энантиоселективности реакции.

Список литературы

1. Злотин С. Г., Кочетков С. В. // Успехи химии. 2015. Vol. 84. P. 1077–1099.
2. Weber E., Toner J. L., Goldberg I. et al. // Crown Ethers and Analogs, John Wiley & Sons Ltd, Chichester, New York, Brisbane, Toronto, Singapore. 1989.
3. Zhidovinova M. S., Fedorova O. V., Rusinov G. L. et al. // Molecular Diversity. 2003. Vol. 6. P. 323–326.
4. Fedorova O. V., Titova Yu. A., Ovchinnicova I. G. et al. // Mendeleev Communication. 2018. Vol. 28. P. 357–358.

** Работа выполнена при поддержке гранта РФФИ 18-53-00026-Бел_а с использованием оборудования Центра коллективного пользования ИОС УрО РАН «Спектроскопия и анализ органических соединений» (ЦКП «САОС»).*

УДК 532.6:54.05:535.37

**С. В. Ткаченко¹, М. С. Ощепков¹,
А. С. Семёнкин¹, Ю. А. Малиновская²,
И. Н. Соловьева¹**

¹Российский химико-технологический университет им. Д. И. Менделеева,
125480, Россия, г. Москва, ул. Героев Панфиловцев, 20,
s.tkach.8@gmail.com,

²ФГБУ «Национальный медицинский исследовательский центр
психиатрии и наркологии имени В. П. Сербского» Минздрава России,
119034, Россия, г. Москва, Кропоткинский пер., 23

МИКРОФЛЮИДНЫЙ СИНТЕЗ ФЛУОРЕСЦЕНТНЫХ МАРКЕРОВ НА ОСНОВЕ 1,8-НАФТАЛИМИДА ДЛЯ ПОЛИЛАКТИДНЫХ НАНОЧАСТИЦ*

Ключевые слова: микрофлюидный синтез, флуоресцентные маркеры, полилактидные наночастицы, 1,8-нафталимид.

В работе проведено сравнение двух методов синтеза новых флуоресцентных маркеров на основе 1,8-нафталимида в классических условиях: в колбе и в микропоток. Получено два флуоресцентных производных, которые далее ковалентно вводили в состав наночастиц (рис. 1). Установлено, что применение условий синтеза в микропоток является целесообразным для